

этому не ослабевает интерес к разработке методов синтеза дигидро- и тетрагидропиримидинов и их производных. Ключевой стадией синтеза большинства гидрированных производных пиримидина является модификация заместителя во втором положении гетероциклического кольца, поэтому мы исследовали реакцию тетрагидропиримидин-2-тионов с эфирами хлоруксусной кислоты.

Ранее было найдено, что при нагревании 1,2,3,4-тетрагидрогидропиримидин-2-тионов с этиловым эфиром хлоруксусной кислоты без растворителя при 110-120 °С получают тиазоло[3,2-а]пиримидины [1]. Эта реакция идет через стадию алкилирования по атому серы с последующей циклизацией по третьему атому цикла с образованием конденсированной гетероциклической структуры. Мы обнаружили, что нагревание при более низкой температуре приводит к образованию только промежуточных продуктов алкилирования. В результате был получен ряд производных 2-(этоксикарбонилметилсульфанил)дигидропиримидинов с различными ароматическими заместителями в пиримидиновом цикле, содержащем также сложноэфирную или ацетильную группу. Изучен гидролиз полученных соединений, в результате чего установлено, что в реакцию вступает только сложноэфирная группа, наиболее удалённая от пиримидинового цикла.

1. Ширяев А.К., Барановская Н.С., Еремин М.С. Синтез 5*H*-тиазоло[3,2-а]пиримидинов // Химия гетероциклич. соединений. 2012. №10. С.1662-1667.

СИНТЕЗ И ОЦЕНКА АНТИБАКТЕРИАЛЬНОЙ АКТИВНОСТИ ПРОИЗВОДНЫХ АКРИДОНУКСУСНЫХ КИСЛОТ С ПЯТИЧЛЕННЫМ ГЕТЕРОЦИКЛИЧЕСКИМ ФРАГМЕНТОМ

Богатырев К.В.⁽¹⁾, Кудрявцева Т.Н.⁽¹⁾, Климова Л.Г.⁽²⁾

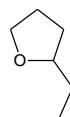
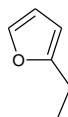
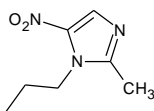
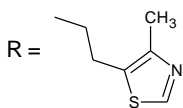
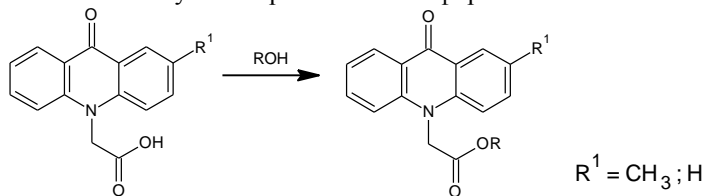
⁽¹⁾ Курский государственный университет
305000, г. Курск, ул. Радищева, д. 33

⁽²⁾ Курский государственный медицинский университет
305041, г. Курск, ул. Карла Маркса, д. 3

Производные акридонуксусной кислоты (АУК) – класс биологически-активных соединений, который находит широкое применение в медицине в качестве противовирусных, иммуномодулирующих [1] и противоопухолевых [2] препаратов. В связи с этим важное практическое

значение представляет поиск и синтез новых перспективных веществ в данном ряду, а также исследование их биологической активности.

Нами была получена серия сложных эфиров АУК и 2-метил АУК:



Оптимальным способом синтеза 4-метил-5-(2-гидроксиэтил)тиазолильных и фуриловых эфиров АУК явился перевод акридонуксусных кислот в бутиловые эфиры с их последующей переэтерификацией соответствующим спиртом, содержащим пятичленный гетероциклический фрагмент, с метилатом натрия в качестве катализатора. 1-(2-Гидроксиэтил)-2-метил-5-нитроимидазольные эфиры получали с высоким выходом взаимодействием АУК с метронидазолом в среде ДМФА в присутствии дициклогексилкарбодиимида и N,N-диметиламинопиридина. Тетрагидрофуриловые эфиры получали этерификацией соответствующей АУК в присутствии серной кислоты.

Чистоту исходных веществ и целевых продуктов контролировали методом ТСХ и ВЭЖХ, состав и структуру веществ подтверждали методами ИК-, УФ-спектроскопии, хроматомасс-спектрометрии.

Некоторые из полученных продуктов были протестированы на антибактериальную активность по отношению к группе тест-штаммов микроорганизмов (*E. coli*, *Ps. Aeruginosa*, *Pr. vulgaris*, *S. Aureus*, *B. subtilis*, *Candida albicans*). Среди исследованных соединений эффективнее всех ингибирует рост микроорганизмов 1-(2-гидроксиэтил)-2-метил-5-нитроимидазольный эфир АУК, также следует отметить высокую активность всех образцов по отношению к *Candida albicans*.

1. Zarubaev V.V., Slita A.V., Krivitskaya V.Z., Sirotkin A.K., Kovalenko A.L., Chatterjee N.K. Direct antiviral effect of cycloferon (10-carboxymethyl-9-acridanone) against adenovirus type 6 in vitro // Antiviral Res. 2003. № 58 (2). P. 131–137.

2. David-Cordonnier M.H., Hildebrand M.P., Baldeyrou B., Lansiaux A., Keuser C., Benzschawel K., Lemster T., Pindur U. Design, synthesis and

biological evaluation of new oligopyrrole carboxamides linked with tricyclic DNA-intercalators as potential DNA ligands or topoisomerase inhibitors // Eur. J. Med. Chem. 2007. № 42 (6). p. 752 – 771.

ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ ИЗАТИНА С АЛКАНОЛАМИНАМИ

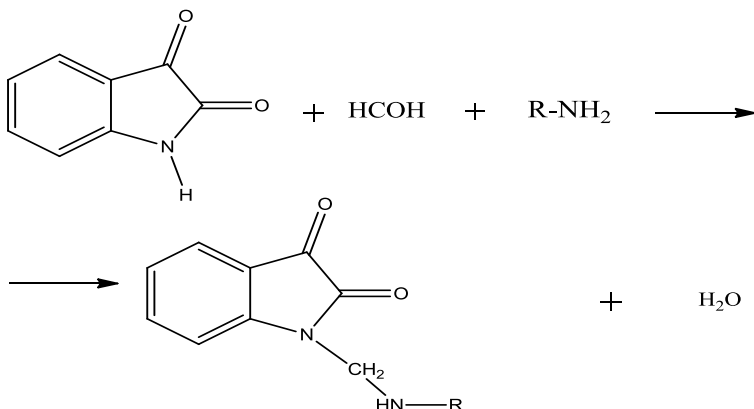
Кобыльской С.Г., Кудрявцева Т.Н., Кометиани И.Б.

Курский государственный университет

305000, г. Курск, ул. Радищева, д. 33

Изатин является одним из производных индола, который на протяжении многих лет привлекает наибольшее внимание исследователей, поскольку открывает широкие возможности получения на его основе многочисленных красителей, лекарственных препаратов, пестицидов, стимуляторов роста растений, аналитических реагентов и др. [1].

С целью поиска новых физиологически активных производных изатина, обладающих высокой биологической доступностью, нами была исследована реакция взаимодействия изатина с алканолaminaми, в частности с трис(гидроксиметил)метанамином, N-метилглюкамином, диэтаноламином с целью получения оснований Манниха по схеме (1), без предварительной защиты карбонильной группы, по аналогии с методом [2]:



Методами ИК-спектроскопии и хроматомасс-спектрометрии показано, что в реакционной смеси преимущественно присутствует не продукт аминотетилирования, а циклический кеталь, образовавшийся в результате взаимодействия изатина с гидроксигруппами алканолamina. Например, с трис(гидроксиметил)метанамином реакция может быть представлена схемой (2):